## (19) 世界知的所有権機関 国際事務局





(43) 国際公開日 2005 年7 月7 日 (07.07.2005)

**PCT** 

## (10) 国際公開番号 WO 2005/060935 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 9/14, 9/06, 9/08, 9/10, 9/20, 9/70, 9/72, 47/02, 47/04, 47/10, 47/12, 47/24, 47/34, 47/36, 31/07, 31/122, 31/198, A61P 3/02

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/015026

(22) 国際出願日:

2004年10月12日(12.10.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願 2003-428462

2003年12月24日(24.12.2003) JP

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社 LTTバイオファーマ (LTT BIO-PHARMA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1056201 東京都港区愛宕 2 丁目 5 番1号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 石原務 (ISHI-HARA, Tsutomu) [JP/JP]; 〒1430024 東京都大田区中央5丁目24-14-101 Tokyo (JP). 水島 裕(MIZUSHIMA, Yutaka) [JP/JP]; 〒1060032 東京都港区六本木6丁目12-3-2402 Tokyo (JP). 鈴木潤(SUZUKI, Jun) [JP/JP]; 〒3360024 埼玉県さいたま市南区根岸2丁目16-2-209 Saitama (JP). 関根準三(SEKINE, Junzou) [JP/JP]; 〒3600013 埼玉県熊谷市中西3丁目4-43-202 Saitama (JP). 山口葉子(YAMAGUCHI, Yoko) [JP/JP]; 〒2580022 神奈川県

足柄上郡開成町牛島 27-17 Kanagawa (JP). 五十嵐 理慧 (IGARASHI, Rie) [JP/JP]; 〒2140036 神奈川県川崎市多摩区南生田 5 丁目 8-2 Kanagawa (JP).

- (74) 代理人: 草間 攻 (KUSAMA, Osamu); 〒1020072 東京 都千代田区飯田橋 4 丁目 5 番 1 2 号 岩田ビル 7 階 草間特許事務所 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

## 添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: DRUG-CONTAINING NANOPARTICLE, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME AND PARENTERALLY ADMINISTERED PREPARATION FROM THE NANOPARTICLE

(54) 発明の名称: 薬物を含有するナノ粒子およびその製造方法、ならびに当該ナノ粒子からなる非経口投与用製剤

(57) Abstract: An external preparation or injectable solution that exerts the effect of enabling percutaneous or transmucous in vivo absorption of fat-soluble drugs and water-soluble drugs not having been satisfactorily attained hitherto and that contains a highly absorbable fat-soluble/water-soluble drug. The injectable solution especially aims at sustained release and target effects. In particular, drug-containing nanoparticles (secondary nanoparticles) are provided by causing primary nanoparticles containing a fat-soluble drug or fat-solubilized water-soluble drug to act with a divalent or trivalent metal salt. Further, drug-containing nanoparticles (tertiary nanoparticles) are provided by first causing primary nanoparticles containing a fat-soluble drug or fat-solubilized water-soluble drug to act with a divalent or trivalent metal salt to thereby obtain secondary nanoparticles and thereafter causing a monovalent to trivalent basic salt to act on the secondary nanoparticles. Still further, there are provided a process for producing these nanoparticles, and a percutaneous or transmucous external preparation or injectable solution in which these nanoparticles are contained.

(57) 要約: これまで十分に達成されていなかった脂溶性薬物、水溶性薬物の経皮または経粘膜による生体内吸収を可能にする効果を有し、高吸収性の脂溶性・水溶性薬物を含有する外用剤、注射剤を提供することであり、注射剤は特に徐放やターゲット効果を目的とする。 詳細には、脂溶性薬物または脂溶性化された水溶性薬物を含有する一次ナノ粒子を、2価または3価の金属塩を作用させることからなる薬物含有ナノ粒子(二次ナノ粒子)、および脂溶性薬物または脂溶性化された水溶性薬物を含有する一次ナノ粒子を2価または3価の金属塩と作用させることにより二次ナノ粒子とし、当該二次ナノ粒子に1価ないし3価の塩基性塩を作用させることから成なる薬物含有ナノ粒子(三次ナノ粒子)、ならびにそれらのナノ粒子の製造方法、さらにそれらのナノ粒子を含有する皮膚または粘膜適用型外用剤および注射用剤である。

